

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年6月9日 (09.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/051949 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 471/04, A61K
31/4545, 31/5377, A61P 3/10, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/017828

(22) 国際出願日: 2004年11月24日 (24.11.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-396242
2003年11月26日 (26.11.2003) JP
特願 2003-419427
2003年12月17日 (17.12.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友製薬株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418510 大阪府大阪市中央区道修町2丁目2番8号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中平 博之 (NAKAHIRA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 木村 英憲 (KIMURA, Hidenori) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 小林 友則 (KOBAYASHI, Tomonori) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 方達 均 (HOCHIGAI, Hitoshi) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP).

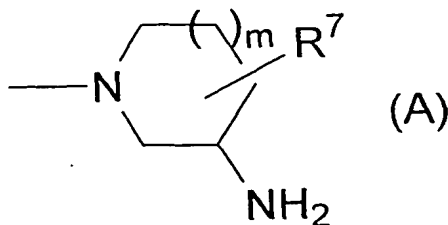
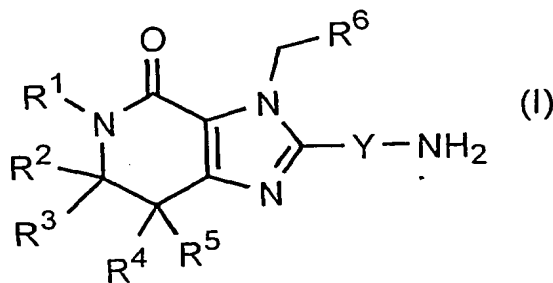
(74) 代理人: 五十部 穰 (ISOBE, Yutaka); 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社 知的財産部内 Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,

[続葉有]

(54) Title: NOVEL CONDENSED IMIDAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規縮合イミダゾール誘導体



(57) Abstract: Disclosed is a compound represented by the formula (I) below which has a high DPP-IV inhibitory activity and is improved in safety, toxicity and the like. Also disclosed is a prodrug of such a compound and pharmaceutically acceptable salts of them. [In the formula, R¹ represents a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R² and R³ independently represent a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R⁴ and R⁵ independently represent a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R⁶ represents a hydrogen atom, an optionally substituted aryl group or the like; and -Y-NH₂ represents a group represented by the following formula (A): (wherein m is 0, 1 or 2; and R⁷ may not exist or one or two R⁷ may exist and independently represent an optionally substituted alkyl group or the like) or the like.]

(57) 要約: DPP-IV阻害活性が高く、安全性、毒性等で改善された化合物として、下記式 (I) で表される化合物もしくはそのプロドラッグ、またはそれらの薬学上許容される塩を提供する。[式中、R¹は水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R²およびR³は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R⁴およびR⁵は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R⁶は水素原子、置換されてもよいアリール基等を表す。-Y-NH₂は式 (A) で表される基等を表す。(mは0、1、または2を表し、R⁷は、存在しないか、1つまたは2つ存在し、各々独立して、置換されてもよいアルキル基等を表す。)]

BEST AVAILABLE COPY

WO 2005/051949 A1



BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,
SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。